І Н С Т Р У К Ц І Я

для медичного застосування лікарського засобу

ОКСИПРОГЕСТЕРОНУ КАПРОНАТ

(OXYPROGESTERONE CAPRONATE)

Склад:

діюча речовина: 1 мл розчину містить гідроксипрогестерону капронат (у перерахуванні на суху речовину) 125 мг;

допоміжні речовини: бензилбензоат, олія оливкова рафінована.

Лікарська форма. Розчин для ін’єкцій олійний.

Основні фізико-хімічні властивості: прозора оліїста рідина від світло-жовтого до зеленувато-жовтого кольору.

Фармакотерапевтична група. Гормони статевих залоз і препарати, що застосовують при патології статевої сфери. Прогестерони. Код АТХ G03D A03.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

«Оксипрогестерону капронат» являє собою синтетичний аналог гормона жовтого тіла (прогестерону). За біологічними властивостями схожий з прогестероном: спричиняє трансформацію слизової оболонки матки з фази проліферації, викликаної фолікулярним гормоном, у секреторну фазу, а після запліднення сприяє її переходу до стану, необхідного для розвитку заплідненої яйцеклітини; зменшує збудливість і скоротливість мускулатури матки і маткових труб, стимулює розвиток кінцевих елементів молочної залози. Порівняно з прогестероном стійкіший в організмі, діє повільніше і має більш тривалий ефект. Після одноразової внутрішньом'язової ін'єкції зберігає свою дію від 7 до 14 днів.

Фармакокінетика.

Після внутрішньом’язової ін’єкції повільно абсорбується з місця введення. Терапевтична концентрація зберігається протягом 7–14 днів.

Клінічні характеристики.

Показання.

Патологічні процеси, зумовлені недостатністю жовтого тіла: загроза викидня; первинна та вторинна аменорея; поліменорея; дисфункціональні маткові кровотечі; гіперпластичні процеси в ендометрії, ендометріоз.

Протипоказання. Підвищена чутливість до компонентів лікарського засобу. Друга половина вагітності, позаматкова вагітність або вагітність, що завмерла, у тому числі в анамнезі, вагінальні кровотечі невстановленого генезу, стан після аборту, порушення функції печінки, захворювання печінки (гепатит, цироз), холестатична жовтяниця у період вагітності або в анамнезі, доброякісна гіпербілірубінемія, печінкова недостатність, ниркова недостатність, порфірія, нервові розлади з явищами депресії, тахікардія, злоякісні пухлини молочних залоз та статевих органів, активна венозна або артеріальна тромбоемболія, тяжкий тромбофлебіт або такі стани в анамнезі.

Протипоказано застосовувати для діагностування вагітності.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. «Оксипрогестерону капронат» послаблює дію препаратів, що стимулюють скорочення міометрія (окситоцин, пітуїтрин), анаболічних стероїдів (ретаболіл, неробол), гонадотропних гормонів гіпофіза. При взаємодії з окситоцином зменшується лактогенний ефект. Лікарський засіб посилює дію діуретиків, гіпотензивних препаратів, імунодепресантів, бромкриптину та системних коагулянтів. Знижує ефективність антикоагулянтів. Змінює ефекти гіпоглікемізуючих засобів. Гестагенну активність знижують індуктори мікросомального окиснення (карбамазепін, гризеофульвін, барбітурати, гідантоїни, рифампіцин). Поєднане застосування β-адреноміметиків та гідроксипрогестерону капронату для запобігання передчасних пологів сприяє зменшенню побічних ефектів β-адреноміметиків.

Гідроксипрогестерону капронат пригнічує метаболізм циклоспорину, що призводить до збільшення концентрації циклоспорину у плазмі крові та ризику виникнення токсичних ефектів.

Особливості застосування. З обережністю слід застосовувати лікарський засіб пацієнтам з артеріальною гіпертензією, серцево-судинними захворюваннями, цукровим діабетом, бронхіальною астмою, епілепсією, мігренню.

З обережністю застосовувати пацієнтам з іншими захворюваннями, що сприяють затримці рідини, хворим із психічними порушеннями в анамнезі, препарат необхідно відмінити при появі перших ознак депресії. Стан пацієнтів, які вже мають в анамнезі психічну депресію, слід ретельно контролювати, а препарат відміняти у випадках тяжкого рецидиву захворювання.

Не слід застосовувати препарат пацієнтам із рідкісними спадковими захворюваннями, такими як непереносимість галактози, недостатність лактази, мальабсорбція глюкози-галактози.

Повідомлялося про реакції гіперчутливості до прогестинів. Гідроксипрогестерону капронат протипоказаний жінкам, які мають гіперчутливість до прогестину в анамнезі.

Прогестини можуть зменшувати толерантність до глюкози, тому у хворих на цукровий діабет потрібно ретельно контролювати концентрацію глюкози в крові. Не слід застосовувати препарат при кровотечах зі статевих шляхів, причина яких не встановлена (варто враховувати нефункціональні причини та провести відповідні діагностичні заходи), та пацієнткам, в анамнезі яких відзначалися захворювання периферичних артерій. При застосуванні препарату необхідно бути уважним до ранніх ознак та симптомів тромбоемболії, а у разі їх виникнення терапію препаратом необхідно припинити.

Необхідно призупинити медикаментозне лікування і провести детальне обстеження, якщо раптово розвивається часткова або повна втрата зору, проптоз, диплопія або мігрень. Використання лікарського засобу слід припинити, якщо при обстеженні виявлено папілоедему або ураження судин сітківки.

Під час лікування рекомендується проведення регулярних оглядів, частота та обсяг яких визначаються індивідуально. Попередній курс обстеження повинен включати огляд грудей і органів малого

таза та тест Папаніколау.

У разі наявності будь-якої прогестогензалежної пухлини, наприклад менінгіоми, в минулому та/або її прогресування у період вагітності, або у разі проведення попередньої гормональної терапії пацієнтка потребує ретельного нагляду лікаря.

При тривалому застосуванні великих доз можливе припинення менструацій.

При введенні гідроксипрогестерону капронату можуть виникати больові відчуття, набряк, свербіж або синці. При підвищеному дискомфорті, виділенні крові або рідини, запальній реакції в місці ін'єкції необхідно звернутися до лікаря.

Вплив тривалого прийому статевих гормонів на функцію гіпофіза, яєчників, надниркових залоз, печінки та матки потребує подальшого вивчення.

При гістологічному дослідженні зразків тканини слід інформувати гістолога про те, що пацієнтка отримувала терапію прогестином.

Застосування у період вагітності або годування груддю. **Препарат застосовувати тільки у I триместрі вагітності при загрозі викидня. Ризик уроджених аномалій, включаючи статеві аномалії у дітей обох статей, пов'язаний з дією екзогенного прогестерону у період вагітності, повністю не встановлений.**

Прогестерон проникає у грудне молоко, тому не слід застосовувати препарат у період годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами. Лікарський засіб може спричиняти порушення зору та підвищену стомлюваність. У період лікування необхідно утримуватися від потенційно небезпечних видів діяльності, що вимагають підвищеної уваги і швидкості психомоторних реакцій.

Спосіб застосування та дози. **Перед використанням ампулу з препаратом злегка підігріти на водяній бані (до 30–40 ºС). У разі випадання кристалів ампулу нагріти на киплячій водяній бані до повного їх розчинення. Вводити внутрішньом'язово та підшкірно.**

При загрозі викидня або викидні, що почався, в I триместрі вагітності вводити по 125–250 мг (1–2 мл 12,5 % розчину) 1 раз на тиждень.

При первинній або вторинній аменореї – безпосередньо після припинення

застосування естрогенних препаратів вводити 250 мг одноразово або за два прийоми.

З метою нормалізації менструального циклу (при поліменореї, дисфункціональних маткових кровотечах) препарат вводити у дозі 65–125 мг (0,5–1 мл 2,5 % розчину) на 20–22-й день циклу.

Для жінок із гіперплазією ендометрія (при відсутності гормонально активних пухлин яєчників) віком до 45 років у I фазі менструального циклу призначати естрогени (етинілестрадіол 0,05 мг на день з 5-го по 25-й день циклу) та «Оксипрогестерону капронат» по 1 мл 12,5 % розчину 1 раз на тиждень на 5-й, 12-й і 19-й день циклу протягом 4–5 циклів. Жінкам віком від 45 років уводити тільки «Оксипрогестерону капронат» по 2 мл 12,5 % розчину 1 раз на тиждень протягом 6–8 менструальних циклів.

Примітка: наявність вологи на голці або шприці може призвести до помутніння розчину, однак це не впливає на активність препарату.

Перед введенням препарат необхідно візуально перевірити на наявність твердих часток та знебарвлення, якщо це дозволяє розчин та упаковка.

Діти. Досвіду застосування препарату дітям немає, тому його не можна застосовувати у педіатричній практиці.

Передозування. При застосуванні підвищених доз препарату частіше виникають побічні ефекти, описані у відповідному розділі. При появі гестагензалежних побічних ефектів лікування необхідно припинити, а після їх зникнення – продовжити у менших дозах. У разі необхідності проводити симптоматичне лікування.

Побічні реакції.

З боку серцево-судинної системи: можливе підвищення артеріального тиску, тахікардія, задишка, порушення кровообігу (інфаркт міокарда та інсульт),тяжкі артеріальні та венозні тромбоемболії, у тому числі легенева емболія (іноді фатальна).

З боку обміну речовин: можливі набряки, затримка рідини, альбумінурія, погана переносимість глюкози, зміни ліпідного профілю плазми.

З боку травної системи: зміни апетиту, здуття живота, біль у животі, запор, діарея, порушення функції печінки та зміни функціональних проб печінки, холестатична жовтяниця, рідко (при тривалому застосуванні) – нудота, блювання.

З боку центральної нервової системи (ЦНС): рідко (при тривалому застосуванні) –

головний біль, мігренозний головний біль, запаморочення, депресія, безсоння, сонливість, слабкість, підвищена втомлюваність, парестезії, біль у спині.

З боку ендокринної системи: рідко (при тривалому застосуванні) – збільшення або зменшення маси тіла, біль і напруження у молочних залозах, зміна вагінальних виділень, нерегулярні маткові кровотечі, ановуляція після лікування, аменорея під час лікування або після нього, олігоменорея, порушення менструального циклу, передменструальний синдром, зміни лібідо, дискомфорт у грудях, гірсутизм, цистит.

З боку статевих органів: спазми матки, порушення з боку зовнішніх статевих органів, такі як печіння, сухість, генітальний свербіж, вагінальні виділення, збільшення продукції цервікального слизу, кров'янисті виділення, кровотеча відміни, проривні кровотечі, вагінальний мікоз.

З боку імунної системи: реакції гіперчутливості, анафілактичні реакції, ангіоневротичний набряк, кропив’янка.

З боку шкіри та підшкірної тканини: алопеція, акне, жовті пігментні плями на обличчі (хлоазма), алергічні реакції на шкірі (висипання, свербіж), мультиформна еритема.

З боку органів зору: порушення зору, тромбоз сітківки, запалення зорових нервів.

Загальні порушення і зміни у місці введення: гарячка; зміни у місці введення, включаючи біль та припухлість, абсцес.

Вплив на плід: надмірна кількість прогестерону може спричинити вірилізацію плода жіночої статі (аж до невизначеності статевої належності).

Прогестини можуть чинити вплив на результати таких лабораторних досліджень: функціональна здатність печінки (зростання затримки сульфобромофталеїну та інші тести); показники системи гемостазу (зростання рівня протромбіну і факторів VII, VIII, IX та X); тести для визначення функції щитоподібної залози (збільшення вмісту йоду, зв’язаного з білками плазми крові, та йоду, що екстрагується бутанолом, зменшення тироксин-зв’язуючої здатності плазми).

Після терапії гідроксипрогестерону капронатом були зареєстровані кілька випадків кашлю, задишки, відчуття здавленості в грудній клітці та/або алергоподібних реакцій. Ймовірність виникнення цих побічних ефектів може зростати при застосуванні більш високих доз.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання. Зберігати в

оригінальній упаковці для захисту від дії світла при температурі не вище 25 ºС. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Несумісність. Препарат не слід змішувати з іншими лікарськими засобами в одній ємності.

Упаковка. По 1 мл препарату в ампулі. По 5 ампул у блістері, по 2 блістери у пачці з картону.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ТОВ «ФЗ «СТАДА», Україна.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 09100, Київська обл., м. Біла Церква, вул. Київська, 37.